

# 

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 22. März 2001 (22.03.2001)

**PCT** 

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO~01/19780~A2

-(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07C 229/00

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP00/08469

(22) Internationales Anmeldedatum:

31. August 2000 (31.08.2000)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 199 43 635.5 13. September 1999 (13.09.1999) D

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (mur für US): ALONSO-ALIJA, Cristina [ES/DE]; Feuerbachstrasse 7, D-42781 Haan (DE). HEIL, Markus [DE/DE]; Am Weissen Stein 43a, D-42799 Leichlingen (DE). FLUBACHER, Dietmar [DE/DE]; Walderstrasse 352, D-40724 Hilden (DE). NAAB, Paul [DE/DE]; Amalienstrasse 29, D-42287 Wuppertal (DE). PERNERSTORFER, Josef [AT/DE]; Alsenstrasse 19, D-42103 Wuppertal (DE). STASCH, Johannes-Peter [DE/DE]; Alfred-Nobel-Strasse 109, D-42651 Solingen (DE). WUNDER, Frank [DE/DE]; Viktoriastrasse 91, D-42115 Wuppertal (DE). DEMBOWSKY, Klaus [DE/US]; 289 Shawmut Avenue,

Boston, MA 02116 (US). PERZBORN, Elisabeth [DE/DE]; Am Tescher Busch 13, D-42327 Wuppertal (DE). STAHL, Elke [DE/DE]; Reuterstrasse 124, D-51467 Bergisch Gladbach (DE).

- (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), curasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Veröffentlicht:

 Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

- (54) Title: NOVEL DERIVATIVES OF DICARBOXYLIC ACID HAVING PHARMACEUTICAL PROPERTIES
- (54) Bezeichnung: NEUARTIGE AMINODICARBONSÄUREDERIVATE MIT PHARMAZEUTISCHEN EIGENSCHAFTEN

$$(R^3)_m$$
  $W-N$   $U-A-R^2$   $(I)_n$ 

- (57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I) as well as the salts and stereoisomers thereof used in the production of medicaments for the treatment of cardiovascular diseases.
- (57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) sowie deren Salze und Stereoisomere, zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von Herz-Kreislauf-Erkrankungen.

### Patentansprüche

- Verwendung von Verbindungen, welche auch in der Lage sind, die lösliche Guanylatcyclase unabhängig von der im Enzym befindlichen Häm-Gruppe zu stimulieren, zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von Herz-Kreislauf-Erkrankungen wie Angina pectoris, Ischämien und Herzinsuffizienz.
- Verwendung von Verbindungen, welche auch in der Lage sind, die lösliche Guanylatcyclase unabhängig von der im Enzym befindlichen Häm-Gruppe zu stimulieren, zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von Arteriosklerose, Hypertonie, thromboembolischen Erkrankungen, venösen Erkrankungen und fibrotischen Erkrankungen wie insbesondere Leberfibrose.
- 3. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)

$$(R^3)_m$$
  $X-(R^1)_n$   $U-A-R^2$  (I)

worin

V fehlt, O, NR<sup>4</sup>, NR<sup>4</sup>CONR<sup>4</sup>, NR<sup>4</sup>CO, NR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>, COO, CONR<sup>4</sup> oder S(O)<sub>0</sub> bedeutet,

worin

R<sup>4</sup> unabhängig von einem weiteren gegebenenfalls vorhandenen Rest R<sup>4</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes
 Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis
 8 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen

oder Arylalkyl mit 7 bis 18 Kohlenstoffatomen bedeutet, wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

- o 0, 1 oder 2 bedeutet,
- Q fehlt, geradkettiges oder verzweigtes Alkylen, geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkindiyl mit jeweils bis zu 12 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine oder mehrere Gruppen aus O, S(O)<sub>p</sub>, NR<sup>5</sup>, CO, NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub> oder CONR<sup>5</sup> enthalten können, und ein oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy oder Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein können, wobei gegebenenfalls zwei beliebige Atome der vorstehenden Kette unter Bildung eines drei- bis achtgliedrigen Rings miteinander verbunden sein können,

- R<sup>5</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, das durch Halogen oder Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,
- p 0, 1 oder 2 bedeutet,
- Wasserstoff, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die auch über N gebunden sein können,

wobei die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkinyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes bis zu 8 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogen, Hydroxy, CN, SR<sup>6</sup>, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>7</sup>COR<sup>10</sup>, NR<sup>7</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>10</sup> oder CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> substituiert sein können,

- R<sup>6</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>7</sup> unabhängig von einem gegebenenfalls vorhandenen weiteren Rest R<sup>7</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O, Arylalkyl mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup> bedeuten,

wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, oder zwei Substituenten aus R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> miteinander unter Bildung eines fünf- oder sechsgliedrigen Rings verbunden sein können, der O oder N enthalten kann, worin

- R<sup>13</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4
  Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen bedeutet,
  wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,
- R<sup>10</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Hetero-

atomen aus der Reihe S, N und/oder O substituiert sein können, die auch über N gebunden sein können,

welche direkt oder über eine Gruppe aus O, S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>, CONR<sup>7</sup>, geradkettigem oder verzweigtem Alkylen, geradkettigem oder verzweigtem Alkendiyl, geradkettigem oder verzweigtem Alkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Oxyalkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Sulfonylalkyl, geradkettigem oder verzweigtem Thioalkyl mit jeweils bis 8 Kohlenstoffatomen gebunden sein können und ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy, Carbonylalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Halogen, SR<sup>6</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, CONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>oder NR<sup>14</sup>COR<sup>17</sup> substituiert sein können,

worin

R<sup>14</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,

R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup> bedeuten, wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

worin

R<sup>18</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu
4 Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10
Kohlenstoffatomen bedeutet,
wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>,
NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder
Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen
substituiert sein kann,

und

 $R^{17}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste mit einem aromatischen oder gesättigten Carbocyclus mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einem aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O anneliert sein können,

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, CN, NO<sub>2</sub> oder NR<sup>19</sup>R<sup>20</sup> bedeutet,

worin

 $R^{19}$  und  $R^{20}$ 

unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeuten,

m eine ganze Zahl von 1 bis 4 bedeutet,

W geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine Gruppe aus O, S(O)<sub>q</sub>, NR<sup>21</sup>, CO oder CONR<sup>21</sup> enthalten können, oder CO, NHCO oder OCO bedeutet,

worin

q 0, 1 oder 2 bedeutet,

R<sup>21</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,

U geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,

A Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet,

welche gegebenenfalls ein- bis dreifach durch Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Halogenalkoxy oder Alkoxy-carbonyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, CN, NO<sub>2</sub> oder NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup> substituiert sein können,

worin

 $R^{22}$  und  $R^{23}$ 

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Carbonylalkyl oder Sulfonylalkyl bedeuten,

R<sup>2</sup> Tetrazolyl, COOR<sup>24</sup> oder CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> bedeutet,

worin

 $R^{24}$ 

Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen

 $R^{25}$  und  $R^{26}$ 

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel  $SO_2R^{27}$  bedeuten,

oder R<sup>25</sup> und R<sup>26</sup> zusammen ein fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der N oder O enthalten kann,

worin

R<sup>27</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen bedeutet,
wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>,
Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

X geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine bis drei Gruppen aus O, S(O)<sub>r</sub>, NR<sup>28</sup>, CO oder CONR<sup>29</sup>, Aryl oder Aryloxy mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen enthalten können, wobei der Arylrest seinerseits einoder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, wobei gegebenenfalls zwei beliebige Atome der vorstehenden Ketten durch eine Alkylkette unter Bildung eines drei- bis achtgliedrigen Rings miteinander verbunden sind,

worin

0, 1 oder 2 bedeutet,

- R<sup>28</sup> Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>29</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- n 1 oder 2 bedeutet;
- R<sup>1</sup> Tetrazolyl, COOR<sup>30</sup> oder CONR<sup>31</sup>R<sup>32</sup> bedeutet,

worin

R<sup>30</sup> Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen

R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel SO<sub>2</sub>R<sup>33</sup> bedeuten,

worin

R<sup>33</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen bedeutet, wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halo-

genalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

sowie deren Stereoisomere und Salze.

4. Verbindungen nach Anspruch 3,

worin

V fehlt, O, NR<sup>4</sup>, NR<sup>4</sup>CONR<sup>4</sup>, NR<sup>4</sup>CO, NR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>, COO, CONR<sup>4</sup> oder S(O)<sub>0</sub> bedeutet,

- R<sup>4</sup> unabhängig von einem weiteren gegebenenfalls vorhandenen Rest R<sup>4</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Arylalkyl mit 7 bis 18 Kohlenstoffatomen bedeutet, wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,
- o 0, 1 oder 2 bedeutet,
- Q fehlt, geradkettiges oder verzweigtes Alkylen, geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkindiyl mit jeweils bis zu 12 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine oder mehrere Gruppen aus O, S(O)<sub>p</sub>, NR<sup>5</sup>, CO, NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub> oder CONR<sup>5</sup> enthalten können, und ein oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy oder Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein können, wo-

bei gegebenenfalls zwei beliebige Atome der vorstehenden Kette unter Bildung eines drei- bis achtgliedrigen Rings miteinander verbunden sein können,

worin

R<sup>5</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, das durch Halogen oder Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

p 0, 1 oder 2 bedeutet,

Wasserstoff, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aro-Y matischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die auch über N gebunden sein können, wobei die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkinyl, geradkettiges oder verzweig-Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 8 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Halogen, Hydroxy, CN, SR<sup>6</sup>, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>7</sup>COR<sup>10</sup>, NR<sup>7</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>10</sup> oder CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> substituiert sein können,

- R<sup>6</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>7</sup> unabhängig von einem gegebenenfalls vorhandenen weiteren Rest R<sup>7</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{11}$  und  $R^{12}$ unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O, Arylalkyl mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup> bedeuten, wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, Hydroxy, CN, NO2, NH2, NHCOR7, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, oder zwei Substituenten aus R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> miteinander unter Bildung eines fünf- oder sechsgliedrigen Rings verbunden sein können, der O oder N enthalten kann,

R<sup>13</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4
Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen bedeutet,
wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

R<sup>10</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch Halogen, Hydroxy, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCOR<sup>7</sup>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O substituiert sein können, die auch über N gebunden sein können,

welche direkt oder über eine Gruppe aus O, S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>, CONR<sup>7</sup>, geradkettigem oder verzweigtem Alkylen, geradkettigem oder verzweigtem Alkendiyl, geradkettigem oder verzweigtem Ozyalkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Oxyalkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Sulfonylalkyl, geradkettigem oder verzweigtem Thioalkyl mit jeweils bis 8 Kohlenstoffatomen gebunden sein können und ein- bis dreifach durch

)

geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy, Carbonylalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Halogen, SR<sup>6</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, CONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>oder NR<sup>14</sup>COR<sup>17</sup> substituiert sein können,

#### worin

R<sup>14</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,

R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup> bedeuten,

#### worin

R<sup>18</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu
4 Kohlenstoffatomen oder Aryl mit 6 bis 10
Kohlenstoffatomen bedeutet,
wobei der Arylrest seinerseits ein- oder mehrfach durch Halogen, CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy,
Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6
Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

und

R<sup>17</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch Halogen,

CN, NO<sub>2</sub>, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert

und/oder die cyclischen Reste mit einem aromatischen oder gesättigten Carbocyclus mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einem aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O anneliert sein können,

- R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- m eine ganze Zahl von 1 bis 4 bedeutet,

sein können;

- W geradkettiges oder verzweigtes Alkylen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- U -CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- A Phenyl oder einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet,

welche gegebenenfalls ein- bis dreifach durch Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, substituiert sein können,

R<sup>2</sup> COOR<sup>24</sup> bedeutet,

worin

R<sup>24</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes
Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

X geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine bis drei Gruppen aus Phenyl, Phenyloxy, O, CO oder CONR<sup>29</sup> enthalten können,

worin

R<sup>29</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

- n 1 oder 2 bedeutet;
- R<sup>1</sup> COOR<sup>30</sup> bedeutet,

worin

R<sup>30</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes
Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet.

5. Verbindungen nach Anspruch 3,

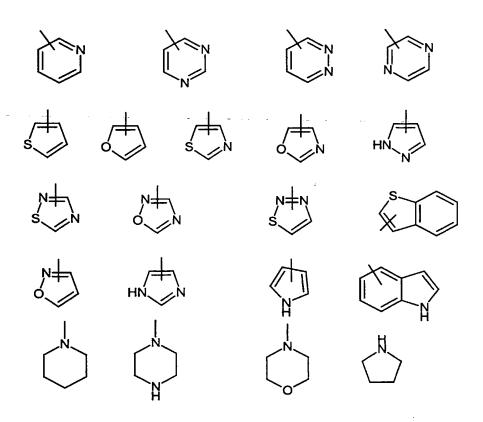
worin

V fehlt, O, S oder NR<sup>4</sup> bedeutet,

worin

R<sup>4</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeutet,

- Q fehlt, geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkindiyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, die einfach durch Halogen substituiert sein können,
- Y H, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, Cyclohexyl, Phenyl, Naphtyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe

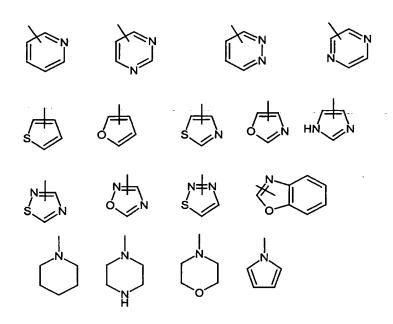


bedeutet, die auch über N gebunden sein können,

wobei die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkinyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, NO<sub>2</sub>, SR<sup>6</sup>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>7</sup>COR<sup>10</sup> oder CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> substituiert sein können,

- R<sup>6</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>7</sup> Wasserstoff, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeuten,
  wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br,
  Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- Propyl, i-Propyl, n- Butyl, sButyl, i- Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann,
  oder zwei Substituenten aus R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup>
  miteinander unter Bildung eines fünf- oder sechsgliedrigen
  Ring verbunden sein können, der durch O oder N unterbrochen sein kann,
- R<sup>10</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeutet, wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann;

und/oder die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch Phenyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe



### substituiert sein können,

welche direkt oder über eine Gruppe aus O, S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>4</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>, CONR<sup>7</sup>, geradkettigem oder verzweigtem Alkylen, geradkettigem oder verzweigtem Alkendiyl, geradkettigem oder verzweigtem Alkyloxy, geradkettigem odeŕ verzweigtem geradkettigem oder verzweigtem Sulfonylalkyl, Oxyalkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Thioalkyl mit jeweils bis 4 Kohlenstoffatomen gebunden sein können und ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, CN, SCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> oder NR<sup>14</sup>COR<sup>17</sup> substituiert sein können,

 $R^{14}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet,

und

 $R^{17}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste mit einem aromatischen oder gesättigten Carbocyclus mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einem aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O anneliert sein können,

- R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Fluor bedeutet,
- m eine ganze Zahl von 1 bis 2 bedeutet,
- W CH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub> bedeutet,

- U -CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- A Phenyl, Pyridyl, Thienyl oder Thiazolyl bedeutet, das gegebenenfalls ein- bis dreifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, F, Cl, Br substituiert sein kann,
- R<sup>2</sup> COOR<sup>24</sup> bedeutet.

worin

R<sup>24</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes
Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,

X geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine bis drei Gruppen aus Phenyl, Phenyloxy, O, CO oder CONR<sup>30</sup> enthalten können,

- R<sup>30</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- n 1 oder 2 bedeutet;
- R<sup>1</sup> COOR<sup>35</sup> bedeutet, worin

)

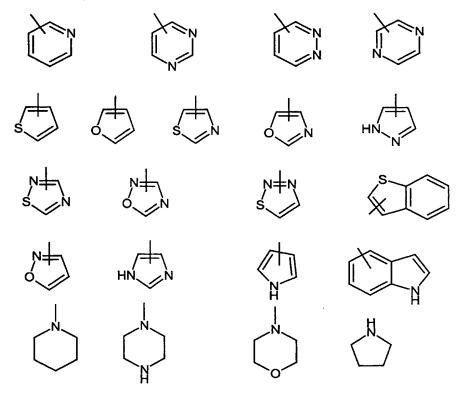
5

 $R^{35}$ 

Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet.

6. Verbindungen nach Anspruch 3,

- V O bedeutet,
- Q geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkindiyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, die einfach durch Halogen substituiert sein können,
- Y H, Cyclohexyl, Phenyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe



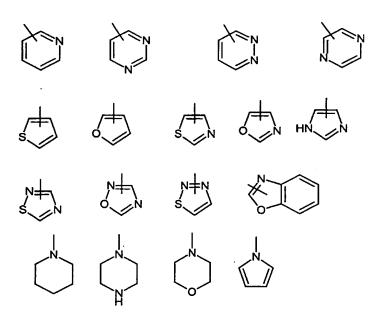
#### bedeutet,

wobei die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkinyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, NO<sub>2</sub>, SR<sup>6</sup>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>7</sup>COR<sup>10</sup> oder CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> substituiert sein können,

- R<sup>6</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>7</sup> Wasserstoff, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeuten,
  wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- Propyl, i-Propyl, n- Butyl, s- Butyl, i- Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann, oder zwei Substituenten aus R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> miteinander unter Bildung eines¹ fünf- oder sechsgliedrigen Ring verbunden sein können, der durch O oder N unterbrochen sein kann,

R<sup>10</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeutet, wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann;

und/oder die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch Phenyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe



substituiert sein können,

welche direkt oder über eine Gruppe aus O, S, SO, SO<sub>2</sub>, geradkettigem oder verzweigtem Alkylen, geradkettigem oder verzweigtem Alkendiyl, geradkettigem oder verzweigtem Alkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Oxyalkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Sulfonylalkyl, geradkettigem oder verzweigtem Thioalkyl mit jeweils bis 4 Kohlenstoffatomen gebunden sein können und ein- bis dreifach

durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, CN, SCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> oder NR<sup>14</sup>COR<sup>17</sup> substituiert sein können,

worin

 $R^{14}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

und

 $R^{17}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste mit einem aromatischen oder gesättigten Carbocyclus mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einem aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoff-

atomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O anneliert sein können,

- R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Fluor bedeutet,
- m eine ganze Zahl von 1 bis 2 bedeutet,
- W -CH<sub>2</sub>- oder -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- U -CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- A Phenyl bedeutet, das gegebenenfalls ein- bis dreifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, F, Cl, Br substituiert sein kann,
- R<sup>2</sup> COOR<sup>24</sup> bedeutet,

- R<sup>24</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes
  Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- X geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine bis drei Gruppen aus Phenyloxy, O, CO oder CONR<sup>30</sup> enthalten können, worin
  - R<sup>30</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

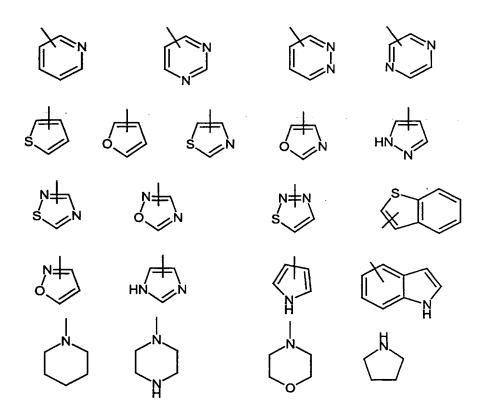
- n 1 oder 2 bedeutet;
- R<sup>1</sup> COOR<sup>35</sup> bedeutet,

worin

R<sup>35</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes
Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet.

7. Verbindungen nach Anspruch 3,

- V O bedeutet,
- Q geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkindiyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, die einfach durch Halogen substituiert sein können,
- Y H, Cyclohexyl, Phenyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe

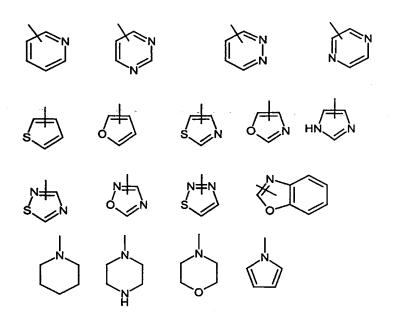


### bedeutet,

wobei die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkinyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkoxy mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, NO<sub>2</sub>, SR<sup>6</sup>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>7</sup>COR<sup>10</sup> oder CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> substituiert sein können,

- R<sup>6</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>7</sup> Wasserstoff, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeuten,
  wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- Propyl, i-Propyl, n- Butyl, s- Butyl, i- Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann,
  oder zwei Substituenten aus R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> miteinander unter Bildung eines fünf- oder sechsgliedrigen Ring verbunden sein können, der durch O oder N unterbrochen sein kann,
- R<sup>10</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, oder Phenyl bedeutet, wobei der Phenylrest ein- bis dreifach durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein kann;

und/oder die cyclischen Reste jeweils ein- bis dreifach durch Phenyl oder einen Heterocyclus aus der Gruppe



substituiert sein können,

welche direkt oder über eine Gruppe aus O, S, SO, SO<sub>2</sub>, geradkettigem oder verzweigtem Alkylen, geradkettigem oder verzweigtem Alkendiyl, geradkettigem oder verzweigtem Alkyloxy, geradkettigem oder verzweigtem Sulfonylalkyl, geradkettigem oder verzweigtem Thioalkyl mit jeweils bis 4 Kohlenstoffatomen gebunden sein können und ein- bis dreifach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxyalkoxy, geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, F, Cl, Br, I, CN, SCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> oder NR<sup>14</sup>COR<sup>17</sup> substituiert sein können,

)

i

)

 $R^{14}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

und

 $R^{17}$ 

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, welche gegebenenfalls weiterhin durch F, Cl Br, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Amino, Acetylamino, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> oder CN substituiert sein können;

und/oder die cyclischen Reste mit einem aromatischen oder gesättigten Carbocyclus mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einem aromatischen oder gesättigten Heterocyclus mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O anneliert sein können,

- R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Fluor bedeutet,
- m eine ganze Zahl von 1 bis 2 bedeutet,
- W -CH<sub>2</sub>- oder -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- bedeutet,

- U -CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- A Phenyl bedeutet, das gegebenenfalls ein- bis dreifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, F, Cl, Br substituiert sein kann,
- R<sup>2</sup> COOH bedeutet,
- X geradkettiges oder verzweigtes Alkylen mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkendiyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, die jeweils eine bis drei Gruppen aus Phenyloxy, O, CO oder CONR<sup>30</sup> enthalten können, worin
  - R<sup>30</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,
- n 1 oder 2 bedeutet;
- R<sup>1</sup> COOH bedeutet.
- 8. Verbindungen nach Anspruch 3,

- V O bedeutet,
- Q CH<sub>2</sub> bedeutet,

- Y Phenyl bedeutet, das mit einem Rest substituiert ist, der aus der Gruppe, bestehend aus 2-Phenylethyl, Cyclohexyl, 4-Chlorphenyl, 4-Methoxyphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 4-Cyanophenyl, 4-Chlorphenoxy, 4-Methoxyphenoxy, 4-Trifluormethylphenoxy, 4-Cyanophenoxy, 4-Methylphenyl ausgewählt ist,
- R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Fluor bedeutet,
- m eine ganze Zahl von 1 bis 2 bedeutet,
- W -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- U -CH<sub>2</sub>- bedeutet,
- A Phenyl bedeutet,
- R<sup>2</sup> COOH bedeutet, wobei R2 in 4-Position zum Rest U angeordnet ist,
- X (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> bedeutet,
- R<sup>1</sup> COOH bedeutet.
- Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), dadurch gekennzeichnet, dass man
  - [A] Verbindungen der Formel (II)

$$(R^3)_m$$
  $W-N$   $U-A-R^2$  (II)

mit Verbindungen der Formel (III)

umsetzt,

worin

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, V, Q, Y, W, X, U, A und m die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

E entweder eine Abgangsgruppe bedeutet, die in Gegenwart einer Base substituiert wird, oder eine gegebenenfalls aktivierte Hydroxyfunktion ist;

oder

[B] Verbindungen der Formel (IV)

$$\begin{array}{ccc}
H & & & \\
N & -X & -R^1 \\
U & & & & \\
U & A - R^2
\end{array}$$
(IV)

mit Verbindungen der Formel (V)

$$(\mathbb{R}^3)_m$$
  $\mathbb{E}$   $(V)$ 

umsetzt,

worin

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, V, Q, Y, W, X, U, A und m die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

E entweder eine Abgangsgruppe bedeutet, die in Gegenwart einer Base substituiert wird, oder eine gegebenenfalls aktivierte Hydroxyfunktion ist;

oder

[C] Verbindungen der Formel (VI)

$$(R^3)_m$$
  $W$   $X$   $R^1$   $(VI)$ 

mit Verbindungen der Formel (VII)

umsetzt,

worin

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, V, Q, Y, W, X, U, A und m die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

E entweder eine Abgangsgruppe bedeutet, die in Gegenwart einer Base substituiert wird, oder eine gegebenenfalls aktivierte Hydroxyfunktion ist;

oder

### [D] Verbindungen der Formel (VIII),

$$(R^3)_m$$
  $W \longrightarrow N \longrightarrow X \longrightarrow R^1$   $Va$   $Va$   $W \longrightarrow A \longrightarrow R^2$   $(VIII)$ 

worin

Va

für O oder S steht und

 $W,A,\,X\,$ ,  $U,\,R^1,\,R^2,\,R^3$  und m die in Anspruch 3 angegebene Bedeutung haben

mit Verbindungen der Formel (IX)

umsetzt,

worin

Q, Y die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

E entweder eine Abgangsgruppe bedeutet, die in Gegenwart einer Base substituiert wird, oder eine gegebenenfalls aktivierte Hydroxyfunktion ist;

oder

### [E] Verbindungen der Formel (X),

$$(R^3)_m$$
 $W \longrightarrow N \longrightarrow X \longrightarrow R^1_b$ 
 $U \searrow A - R^2_b$ 
 $(X)$ 

worin

R<sup>3</sup>, V, Q, Y, W, X, U, A und m die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

R<sup>1</sup><sub>b</sub> und R<sup>2</sup><sub>b</sub> jeweils unabhängig für CN oder COOAlk stehen, wobei
Alk für einen geradkettigen oder verzweigten Alkylrest
mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht,

mit wässrigen Lösungen starker Säuren oder starker Basen in die entsprechenden freien Carbonsäuren überführt.

oder

## [F] Verbindungen der Formel (XI)

$$(R^3)_m$$
 $W-N-X-R^1$ 
 $U_{A-R^2}$ 
 $(XI)$ 

worin

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, V, Q, Y, W, X, U, A und m die gleichen Bedeutungen wie in Anspruch 3 haben,

L für Br, I oder die Gruppe CF<sub>3</sub>SO<sub>2</sub>-O steht,

mit Verbindungen der Formel (XII)

M-Z (XII)

worin

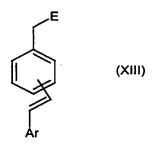
M für einen Aryl oder Heteroarylrest, einen geradkettigen oder verzweigten Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylrest oder Cycloalkylrest oder für einen Arylalkyl, einen Arylalkenyl- oder einen Arylalkinylrest steht,

Z für die Gruppierungen -B(OH)<sub>2</sub>, -CH≡CH, -CH=CH<sub>2</sub> oder -Sn(nBu)<sub>3</sub> steht

in Gegenwart einer Palladiumverbindung, gegebenenfalls zusätzlich in Gegenwart eines Reduktionsmittels und weiterer Zusatzstoffe und in Gegenwart einer Base umsetzt;

oder

### [G] Verbindungen der Formel (XIII)



worin

- Ar für einen Aryl oder Heteroarylrest steht,
- E eine Abgangsgruppe bedeutet, die in Gegenwart einer Base substituiert wird.

nach Verfahren D mit Verbindungen der Formel (VIII) umsetzt und die so erhaltenen Verbindungen der Formel (XIV)

mit Wasserstoff in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

# 10. Verbindungen der Formel (II)

$$(R^3)_m$$
 $W-N$ 
 $U-A-R^2$ 
 $(II)$ 

worin

V, Q, Y,  $R^3$ , m, W, N, U, A and  $R^2$ 

die in Anspruch 3 angegebene Bedeutung haben.

# 11. Verbindungen der Formel (IV)

$$\begin{array}{ccc}
H \\
N - X - R^1 \\
U \\
\Delta - R^2
\end{array} (IV)$$

U, A, X, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup>

die in Anspruch 3 angegebene Bedeutung haben.

### 12. Verbindungen der Formel (VI)

$$(R^3)_m$$
  $W$   $X$   $R^1$ 

worin

V, Q, Y, R<sup>3</sup>, m, W, X und R<sup>1</sup>

die in Anspruch 3 angegebene Bedeutung haben.

- 13. Arzneimittel enthaltend mindestens eine Verbindung der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche.
- 14. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Herz-Kreislauf-Erkrankungen.
- 15. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von Angina pectoris, Ischämien und Herzinsuffizienz.
- 16. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung

von Hypertonie, thromboembolischen Erkrankungen, Arteriosklerose und venösen Erkrankungen.

- 17. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von fibrotischen Erkrankungen.
- Verwendung nach Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass die fibrotische Erkrankung Leberfibrose ist.